

31

⑩日本国特許庁(JP) ⑩特許出願公表
 ⑩公表特許公報(A) 平5-505520

⑩公表 平成5年(1993)8月19日
 Int. Cl.⁸ 疎列記号 庁内登録番号 審査請求 未請求
 C 12 N 15/11 A B B 8314-4C 子審査請求 有 部門(区分) 1(1)
 A 61 K 31/70 A B C 8314-4C※ (全13頁)
 37/02

⑩発明の名称 全身性紅斑性狼瘡の治療のための生体内で安定なポリマーおよびポリヌクレオチドの複合体
 ⑩特 願 平3-503584
 ⑩出 願 平3(1991)1月15日
 ⑩翻訳文提出日 平4(1992)7月16日
 ⑩国際出願 PCT/US91/00293
 ⑩国際公開番号 WO91/10426
 ⑩国際公開日 平3(1991)7月25日
 優先権主張 ⑩1990年1月16日⑩米国(US)⑩466,138
 ⑩発 明 者 コンラッド、マイケル ジェ アメリカ合衆国 カリフォルニア 92129 サンディエゴ、ペナノ
 イー バ ストリート 11336
 ⑩出 願 人 ラ ホヤ ファーマシューティ アメリカ合衆国 カリフォルニア 92121 サンディエゴ、ナンシ
 カル カンパニー リッジ ドライブ 6455
 ⑩代 理 人 弁理士 山本 秀策
 ⑩特 定 国 FI, JP, NO
 最終頁に続く

請求の範囲

1. (a) 生体内で安定なポリマーと、(b) 各々が二本鎖ポリヌクレオチドと結合した、少なくとも約20個の塩基対よりなる多様な二本鎖ポリヌクレオチドとの複合体であり、該二本鎖が各々ヒト全身性紅斑性狼瘡の抗dsDNA自己抗体に対して著しい結合活性を有する、複合体。
 2. 前記生体内で安定なポリマーが、β-グルタミン酸(E)とβ-リジン(K)とのコポリマーであり、分子量が約5,000から約10,000であり、そしてE:Kモル比が約10:10である、請求項1に記載の複合体。
 3. 前記二本鎖の長さが実質的に均一である、請求項1もしくは2に記載の複合体。
 4. 前記二本鎖が、ヌクレオチド組成において実質的に均一である、請求項3に記載の複合体。
 5. 前記二本鎖の長さが10から250bpである、請求項1、2、3、もしくは4に記載の複合体。
 6. 前記二本鎖が末端の1つまたはその近くでポリマーに結合する、請求項1、2、3、4、もしくは5に記載の複合体。
 7. 前記二本鎖が、二本鎖の一方の端の末端の1つまたはその近くに位置する官能基と、前記ポリマーの遊離アミノ基との反応により該ポリマーに結合する、請求項6に記載の複合体。
 8. 前記二本鎖ポリヌクレオチドが、異なる2から4個基

の相補的な多量体反応ユニットにより構成される、請求項1、2、3、4、5、6、もしくは7に記載の複合体。
 9. 前記二本鎖ポリヌクレオチドが、ポリd(CC):ポリd(CG)、ポリd(AT):ポリd(TA)、ポリd(IC):ポリd(CP)、ポリd(AC):ポリd(TG)、もしくはポリd(AG):ポリd(TC)である、請求項8に記載の複合体。
 10. 前記二本鎖ポリヌクレオチドが、(AC)₂₀:(TC)₂₀である、請求項1もしくは2に記載の複合体。
 11. 高次的に受容され得る注射可能な製剤とともに処方される、請求項1、2、3、4、5、6、7、8、9、もしくは10に記載の複合体を含む、狼瘡治療のための調剤組成物。
 12. 少なくとも約20個の塩基対よりなる一本鎖ポリヌクレオチドであって、末端の1つまたはその近くに、遊離アミノ基と反応する官能基を有し、そして相補的な一本鎖ポリヌクレオチドにアニールされると、ヒト全身性狼瘡の抗dsDNA自己抗体に対する著しい結合活性を有する、一本鎖ポリヌクレオチド。
 13. 前記一本鎖ポリヌクレオチドが、異なる2から4個基の多量体反応ユニットにより構成される、請求項12に記載の一本鎖ポリヌクレオチド。
 14. 請求項1に記載の複合体を作製する方法であり、
 (a) 各々が少なくとも約20個の塩基対よりなり、末端の1つまたはその近くに、アミノ基に反応する官能基を有する